

DISINTEGRATING AGENT

W 1796-01

Patent number: JP58032828
Publication date: 1983-02-25
Inventor: NISHIMOTO KATSUYA; NISHIYAMA MASAYOSHI; ITOU ATSUYA; ASANO YUUSUKE
Applicant: AJINOMOTO KK; TAIYO KAGAKU KK
Classification:
- international: A61K9/20; A61K47/00
- european:
Application number: JP19810130013 19810819
Priority number(s): JP19810130013 19810819

[View INPADOC patent family](#)

Abstract of JP58032828

PURPOSE: A disintegrating agent, containing a modified starch having a specific swelling degree, and having improved disintegrating and tableting properties. **CONSTITUTION:** A disintegrating agent containing a modified starch, e.g. obtained by processing a subterranean stem of a potato, sweet potato or tapioca, and having a swelling degree of 3.0-6.0, preferably 4.0-5.5. The modified starch is obtained by kneading a hydrated and humidified starch having a moisture of 30-60%, preferably 40-55%, in a speed kneader, etc., gelatinizing the kneaded starch under heating at 70-150, preferably 80-120 deg.C, cooling the kneaded starch to 20 deg.C or below, partially crystallizing the starch, and drying and pulverizing the crystallized starch. The amount necessary for the agent is at least 30% or more, preferably 50% or more, in the disintegrating agent, and a disintegrating agent, e.g. another starch, surfactant or calcium carboxymethyl cellulose, may be used together.

⑫ 公開特許公報 (A)

昭58-32828

⑬ Int. Cl.³
A 61 K 47/00
// A 61 K 9/20

識別記号

厅内整理番号
7057-4C
7057-4C⑭ 公開 昭和58年(1983)2月25日
発明の数 1
審査請求 未請求

(全4頁)

⑮ 崩壊剤

⑯ 特願 昭56-130013
 ⑰ 出願 昭56(1981)8月19日
 ⑯ 発明者 西元勝也
 四日市市城東町6-10
 ⑯ 発明者 西山昌良
 四日市市坂部ガ丘2丁目1の56
 ⑯ 発明者 伊藤篤也

四日市市三滝台1-14-9
 ⑯ 発明者 浅野悠輔
 四日市市赤堀2-4-5
 ⑰ 出願人 味の素株式会社
 東京都中央区京橋1丁目5番8号
 ⑰ 出願人 太陽化学株式会社
 四日市市赤堀新町9番5号

明細書

1 発明の名称 崩壊剤

2 特許請求の範囲

- 膨潤度3.0～6.0の加工澱粉を含有する崩壊剤。
- 加工澱粉が、澱粉を糊化、冷却、次いで乾燥して得られた膨潤度3.0～6.0の澱粉である特許請求の範囲第1項記載の崩壊剤。

3 発明の詳細な説明

本発明は、崩壊剤、更に詳しくは医薬品、食料品等の粉体を圧縮成形して得られる錠剤に液中崩壊性を付与する目的で添加される崩壊剤に関する。

従来、錠剤の崩壊剤としては澱粉、カルボキシメチルセルロースのアルカリ土類金属塩、アルギン酸ナトリウム、寒天などが使用されており、特に澱粉は安価であることの他、天然物であり安全性が極めて高い、それ自体が安定である、錠剤中の主薬との反応性がない等の理由に

より広く用いられている。しかしながら澱粉は吸水による膨潤度が小さく、その使用量が少ないと崩壊性が弱く、また多量に用いて打錠を行なう場合には、例えばキヤッピングやラミネーティングを生じ易いの欠点を有する。また、カルボキシメチルセルロースのアルカリ土類金属塩は、崩壊性は良いが澱粉に較べて高価であること、化学的合成品であるため使用上の制限があること、錠剤中の主薬の種類によつては反応性があるため使用出来ない場合があり、汎用性に欠ける。

一方、アルギン酸ナトリウム、寒天などは高価であることや打錠適性が良くない等の欠点があり、ほとんど用いられていない。

本発明者は、従来の崩壊剤に較べてより優れた崩壊剤を開発すべく鋭意研究した結果、膨潤度が3.0～6.0である加工澱粉を使用することにより崩壊性にすぐれ、かつ打錠適性にすぐれた崩壊剤が得られることを見い出し、この発見に基づき本発明を完成するに至つた。

膨潤度の測定は次の方法により測定することが

できる。

150メッシュ通過の澱粉試料1gに水50mlを加え分散せしめ、30分間30℃の恒温槽の中で攪拌振盪後遠心分離(3000rpm 10分間)しゲル層と上澄層に分ける。ついでゲル層の重量を測定しこれをaとする。次に、ゲル層を乾燥し(105℃、4時間)重量を測定し、bとする。膨潤度はa/bで表わす。

本発明方法にて用いる加工澱粉は種々の方法にて、調製可能であるが、例えば加水調湿した澱粉を糊化(糊化)し、次いで冷却し一部昇化(結晶化)した後、乾燥粉碎することにより好都合に調製することができる。上記方法において、第一工程の調湿澱粉の水分量は、次工程の作業上の容易さ及び最終加工澱粉の品質により、若干異つてくるが、通常30～60%であり、好ましくは40%より大なる比較的高水分含量が有利であつて、更により好ましくは40～55%である。加水した澱粉は、例えばスピードニーダー、パドルミキサー、リボンミキサーにより混練する。

- 3 -

当時間低温にて保持する。保持時間は、冷却温度と相関があり、一定ではないが、例えば15℃にあつては、約2時間、5℃にあつては、30分程度である。

この様にして得た生地を次いで乾燥粉末化するのであるが、乾燥効率をよくするため、粗碎した上で、水分6～15%程度に乾燥、例えば、流動乾燥する。乾燥温度、特に水分含量の高い乾燥初期の温度は、最終製品の膨潤度に影響を与える。温度が80℃以下、好ましくは60℃以下にて乾燥することが重要である。

以上の如くして得た乾燥物を適度の粒度、例えば、150メッシュ程度に迄粉碎することにより、本発明の原料加工澱粉となるのである。

本発明にあつては、膨潤度3.0～6.0の加工澱粉を使用するのであるが、膨潤度4.0～5.5がより好ましい。

膨潤度が前記範囲外、即ち、3.0よりも低い場合には、生澱粉と同程度の崩壊性しか得られず、また6.0より高い場合には、澱粉の一部が溶解し

この様にして得た調湿澱粉は、次に70～150℃、好ましくは80～120℃にて加熱糊化するのであるが、糊化方法は、特に限定ではなく、蒸煮、蒸練機、エクストルーダー等による加熱押し出し等の手段を使用することができる。しかしながら、本発明者の知見によれば、この糊化工程中及び以下の工程にて糊化澱粉を激しく混練することは、加工澱粉の膨潤度に影響を与える、引いては特性を低下させるので、好ましくないことが判明した。従つて、加熱糊化は、エクストルーダー、特にスクリュー圧縮比の小さい(好ましくは1:1～1.2:1)エクストルーダーを使用し且つ低温にて(100mm/cm以下にて)連続的に押し出し完全に糊化するのが品質及び工程管理上有利である。この様にして得た糊化澱粉は次いで、空冷、水冷、冷蔵、冷凍等の手段にて冷却し糊化澱粉の一部を結晶化する。

この冷却工程は品温が20℃以下、好ましくは10℃以下になる様に冷却し糊化澱粉の一部を結晶化し、前述の膨潤度を有する澱粉とすべく、適

- 4 -

糊状を呈する様になり、その結果、糊剤の内部への水の浸透が阻害され、崩壊が不良となるため、効果をあげることができない。

本発明にて使用するこの様な加工澱粉はその起源を、問うものではなく、例えば、馬鈴薯、甘藷、タピオカ等の地下茎澱粉、小麦、とうもろこし、米などの地上澱粉の生澱粉及び物理的、化学的あるいは生物学的処理を施したものであつてもよく、その1種又は2種以上の混合物であつてもよい。しかしながら、生澱粉からの加工澱粉にて充分効果をあげることができるので経済的には生澱粉を加工処理したものが有利である。また、本発明に係る崩壊剤に使用する原料として上記の特性を有する加工澱粉を、単独使用するのが最も効果的であるが、本加工澱粉が崩壊剤中少なくとも30%以上、より好ましくは50%以上あれば通常効果は発現するので、他種澱粉や界面活性剤あるいはカルボキシメチルセルロースカルシウム等の崩壊剤との併用も可能である。

以下、実施例により本発明を詳細に説明する。

- 5 -

実施例 1

とうもろこし澱粉に水を添加し、水分含量を 5.0% に調整し、スピードニーダーによりよく混和し、これをバレル長 1,200%、7.5 回転の速度で回転する直徑 5.0% のスクリューを有するエクストルーダー（スクリュー圧縮比 1:1）に連続的に供給した。エクストルーダーのバレル温度は、供給口付近で 50°C、中間部分を 110°C、ダイ部分を 70°C となる如く設定し、圧力を 3.0 kg/cm² に保つた。

かかる条件下にエクストルーダーの圧出孔より押し出された生地を 20 分間水冷した後、5°C 冷蔵庫で冷却し、適宜、切断した後、60°C の熱風にて水分含有量約 8% 迄乾燥した。ついで得られた乾燥物を衝撃式粉碎機で粉碎し、部分して 150 メッシュ通過の加工澱粉末（「製品 1」という。）を得た。本品の膨潤度は 4.6 で、一方未処理澱粉では 1.7 であった。

- 7 -

品の膨潤度は 5.4 で、一方未処理澱粉では、1.7 であった。

次に、実施例 1～3 により得た製品 1～3 を用いて、崩壊剤として表 1 に示した处方によりテスト錠を作成した。得られたテスト錠について、日本薬局方（第 9 改正）の崩壊試験法（錠剤）に準じて崩壊試験を行ない、表 2 に示す評価結果を得た。

表 1

原 料	テス							
	1	2	3	4	5	6	7	8
局 方 乳 糖	8.9	8.9	8.9	8.9	8.9	8.9	8.9	9.9
ステアリン酸カルシウム	1	1	1	1	1	1	1	1
製 品 1	1.0					5	5	
“ 2		1.0						
“ 3			1.0					
カルボキシメチルセルロースカルシウム				1.0		5		
とうもろこし澱粉					1.0		5	

実施例 2

甘藷澱粉 8.0 部、コーンスター 2.0 部の混合物に水を添加し、混練し、水分含量 4.0% に調湿し、これを実施例 1 で用いたと同一のエクストルーダーを用い中間部温度を 100°C にした外は実施例 1 と同様にして糊化した。圧出孔より押し出された生地は 5°C 冷蔵庫で冷却した後、実施例 1 と同じ条件により乾燥、粉碎を行ない、篩別して 150 メッシュ通過の加工澱粉末（「製品 2」という。）を得た。本品の膨潤度は 4.7 で一方未処理澱粉では 1.7 であった。

実施例 3

甘藷澱粉に水を添加し、水分含量 5.0% に調湿し、これを中間部温度を 100°C に設定した実施例 1 にて用いたと同一のエクストルーダーに連続的に供給し糊化した。圧出孔より押し出された生地を、実施例 1 と同じ条件により、冷却、乾燥次いで粉碎を行ない、篩別して 150 メッシュ通過の加工澱粉末（「製品 3」という。）を得た。本

- 8 -

上記の配合处方の混合粉を直打法により直徑 7%、1.80 mg/1 錠に打錠し、錠剤硬度 5～8 kg/cm² の各種テスト錠を調製した。

表 2

テス	錠剤崩壊時間(分)			
	錠剤硬度 5 kg/cm ²	6 kg/cm ²	7 kg/cm ²	8 kg/cm ²
1	4.0 (分)	5.3 (分)	6.5 (分)	8.3 (分)
2	4.0	5.2	6.4	8.3
3	3.9	5.1	6.3	8.0
4	3.9	5.2	6.4	8.3
5	9.8	15.3	(キヤツピング)	(キヤツピング)
6	4.0	5.0	6.5	8.2
7	7.5	10.8	12.3	14.5
8	32.2	(キヤツピング)	(キヤツピング)	(キヤツピング)

上記結果から明らかなるごとく本発明による崩壊剤は、従来の崩壊剤の内、最も崩壊剤が強いカル

- 9 -

ボキシノチルセルロースカルシウムに近い崩壊性を有し、また他の崩壊剤と併用する時にあつてもその効果が大で、更にキャッピング等を生じにくくする等の打錠性改良効果も期待出来る。しかも澱粉を物理的処理のみによつて加工したものであるため、極めて安全性が高く、澱粉の特長である安全性及び主薬との低反応性を有することの他、安息角も 40° 以下と流動性にも富むため打錠適性が良いこと、また原料が澱粉であり、かつ複雑な製法を必要としないため、安価に供給出来る等種々の利点を有するもので医薬品錠剤をはじめ食料品錠剤の品質改良に大意に寄与するものである。

特許出願人 味の素株式会社
太陽化学株式会社

- 11 -